

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2004 年 12 月 29 日 (29.12.2004)

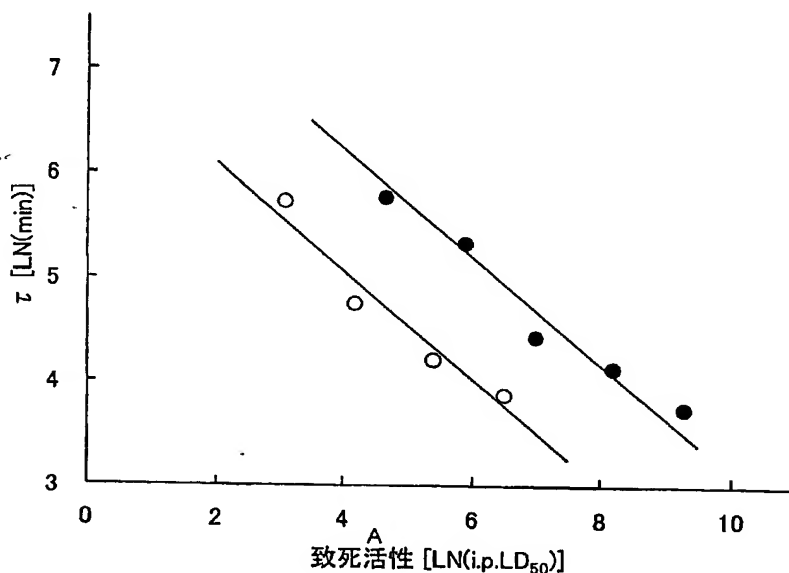
PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/112821 A1

- (51) 国際特許分類⁷: A61K 38/16, A61P 25/00
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2004/008963
- (22) 国際出願日: 2004 年 6 月 18 日 (18.06.2004)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2003-175722 2003 年 6 月 20 日 (20.06.2003) JP
特願2003-377101 2003 年 11 月 6 日 (06.11.2003) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 参天製薬株式会社 (SANTEN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5338651 大阪府大阪市東淀川区下新庄 3 丁目 9 番 19 号 Osaka (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小崎 俊司 (KOZAKI, Shunji) [JP/JP]; 〒5840071 大阪府富田林市藤沢台 3 丁目 5 - 2 - 208 Osaka (JP). 杉本 央 (SUGIMOTO, Nakaba) [JP/JP]; 〒6660257 兵庫県川辺郡猪名川町白金 1 丁目 8 9 番 3 号 Hyogo (JP). 嶋澤 雅光 (SHIMAZAWA, Masamitsu) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町 8 9 1 6 - 1 6 参天製薬株式会社内 Nara (JP). 原 英彰 (HARA, Hideaki) [JP/JP]; 〒6308002 奈良県奈良市二条町 3 - 4 - 25 Nara (JP).
- (74) 代理人: 日比 紀彦, 外 (HIBI, Norihiko et al.); 〒5420086 大阪府大阪市中央区西心斎橋 1 丁目 1 3 番 1 8 号イナバビル 3 階 キシモト特許事務所内 Osaka (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, [続葉有]

(54) Title: REMEDIES FOR DISEASES WITH HYPERMYOTONIA

(54) 発明の名称: 筋緊張亢進性疾患の治療剤



B
○ : 被験液 (M 体毒素)
● : 比較液 (L 体毒素及び L L 体毒素の混合物)
C

A...LETHAL ACTIVITY
B...TEST SOLUTION (TOXIN M)
C...COMPARATIVE SOLUTION (MIXTURE OF TOXINS L AND LL)

(57) Abstract: Type A botulinum toxin M and a mixture of botulinum toxins L and LL are compared and examined in neurotransmission inhibitory activity and therapeutic index. As a result, it is found out that the type A botulinum toxin M has characteristics of: 1) having an excellent neurotransmission inhibitory activity; 2) showing a high therapeutic index; 3) showing a low antigenicity; and 4) suffering from little reduction in efficacy even after repeatedly administered, compared with the mixture of botulinum toxins L and LL. Owing to these characteristics, the type A botulinum toxin M is particularly useful as remedies for diseases caused by hypermyotonia such as strabismus, blepharism, hemifacial spasm, convulsive stiff neck, post-stroke paralysis, pediatric brain paralysis, convulsive voice disorder, headache, lumbar pain, neck pain, back pain, stiff shoulder, insufficient hypomyotonia accompanying Parkinson's disease or multiple sclerosis, fascial pain syndrome, spasm in masticatory muscle, chronic anal fissure, incontinent urination, teeth gnashing, facial myokimia, tic, topical dystonia and wrinkle.

[続葉有]

WO 2004/112821 A1



BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約: A型ボツリヌス毒素のM体とL体・LL体の混合物の神経筋伝達阻害活性および治療指数が比較検討された。A型ボツリヌス毒素のM体は、L体・LL体の混合物よりも1) 神経筋伝達阻害活性に優れ、2) 治療指数が高く、3) 抗原性が低く、4) 繰り返し投与しても効果が減弱しにくい、といった特徴を有しているので、斜視、眼瞼痙攣、片側顔面痙攣、痙攣性斜頸、脳卒中後の麻痺、小児脳性麻痺、痙攣性発声障害、頭痛、腰痛、頸痛、背中痛、肩こり、パーキンソン病や多発性硬化症などの発症時に起こる筋弛緩不全、筋膜痛症候群、咀嚼筋攣縮、慢性裂肛、尿失禁、歯ぎしり、顔面ミオキミア、チック、局所性ジストニー、痙攣などの筋緊張亢進に起因する疾患の治療剤として特に有用である。